- Cours de 3 ème Année pharmacie -

FURANNE ET MEDICAMENTS DERIVES

Présenté par: Dr. B.GUERFI

I- FURANNE:

✓ **Structure:**

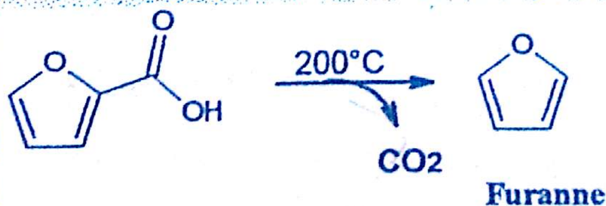


Furanne

** Hétérocycle pentagonal avec **l'oxygène** comme hétéroatome.

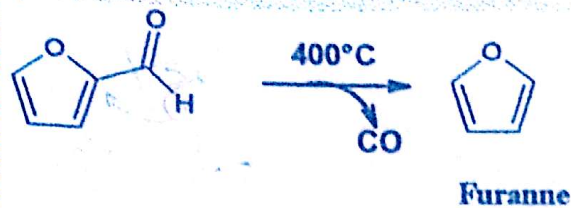
✓ **Préparation:**

1- Par décarboxylation de l'acide Furoique:

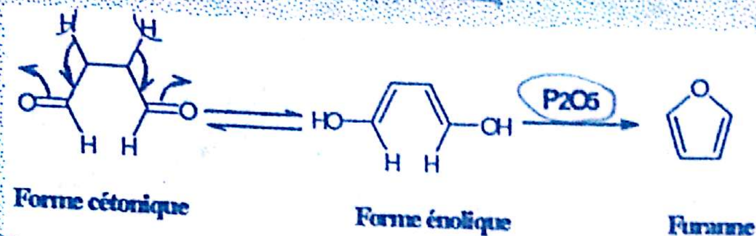


Furanne

2- A partir du Furfural:



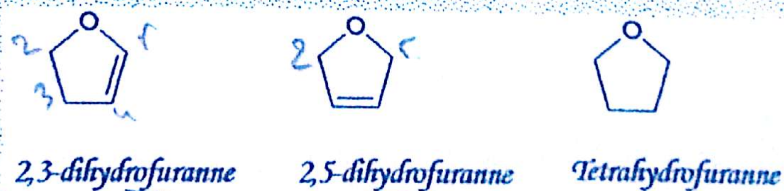
3- Par cyclisation de l'aldéhyde succinique en présence de P_2O_5:



II- DERIVES :

A coté de cet hétérocycle, sont étudiés les dérivés oxygénés et hydrogénés:

- **Les dérivés hydrogénés:**



- **Les dérivés oxygénés:**

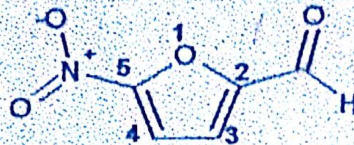


A-NITROFURANES:

✓ **Définition:**

-Sont des dérivés du 5-nitrofurfural, qui constitue la fraction commune d'un certain nombre de composés utilisés comme antiseptiques.

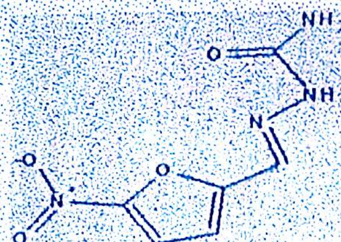
- Le groupement aldéhydique y est combiné avec divers réactifs azotés. Les fraction non furaniques confèrent aux diverses molécules certaines caractéristiques qui en déterminent les usages: antisepsie externe, antisepsie interne (intestinale, urinaire........)



5-nitrofurfural

✓ Semicarbazone du 5-Nitrofurfural:

✓ *Structure:*

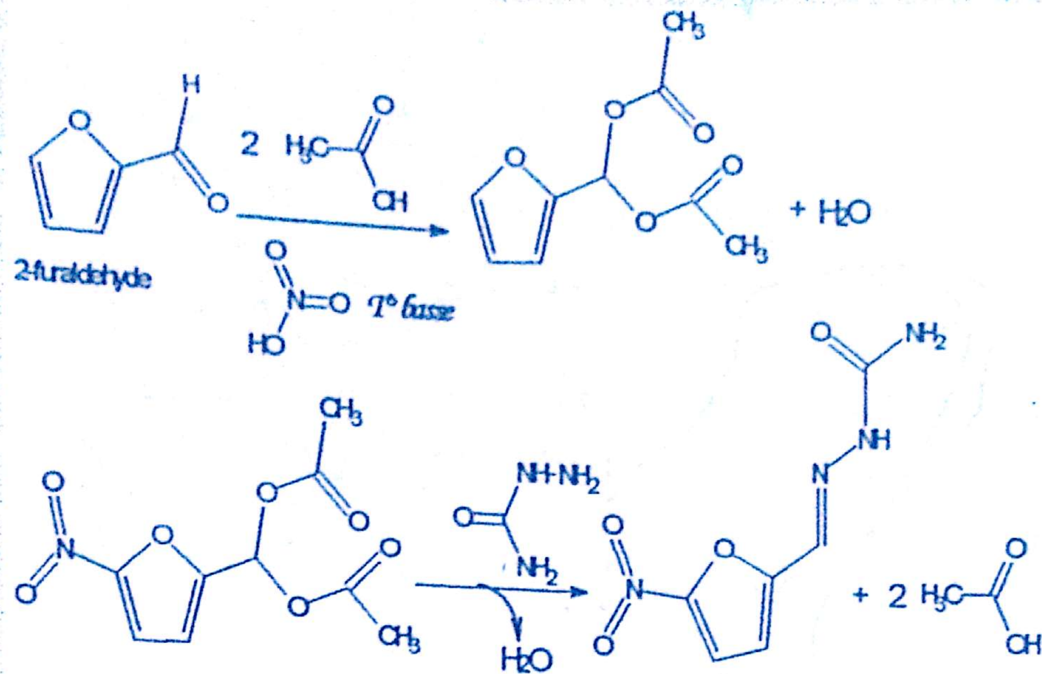


Nitrofural (DC)
FURALONE (ND)

✓ *Préparation:*

** Nitration du furfural à l'aide d'un mélange acétonitrique;

** le produit obtenu est ensuite condensé avec une molécule de Semicarbazide.



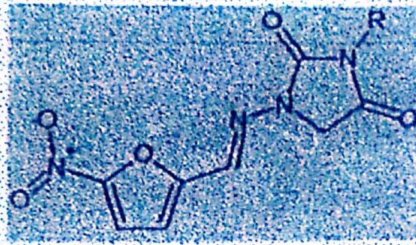
✓ *Emploi:*

•Antiseptique à usage **externe**, on peut l'utiliser pour le traitement des plaies et de certaines affections de la peau (Solution de 2‰).

• En gynécologie, elle est présentée en ovules contre des infections à Trichomonas vaginalis.

* En médecine vétérinaire, elle est préconisée pour usage interne: **Salmonelloses et Coccidioses.**

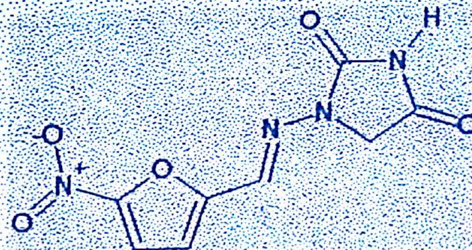
✓ ***Nitrofuranes urinaires:*** (interne)



DCI	Spécialité	R
Nitrofurantoïne	FURADANTINE	H
Nifurtoïnol	URFADYN	CH2OH

➤ ***Nitrofurantoïne (DCI):***

✓ ***Structure:***



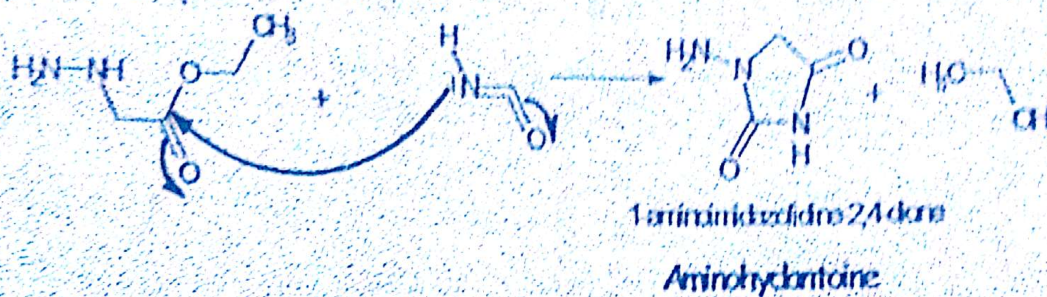
1-{ [(5-nitro-fur-2-yl)méthylène]amino}imidazolidine-2,4-dione

✓ ***Préparation:***

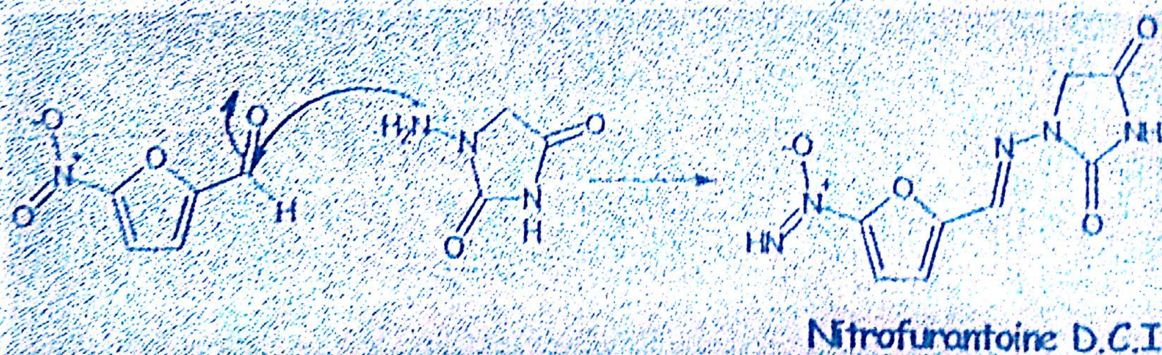
Par Condensation du **nitrofurfural** avec l'**aminohydantoine**.

** Synthèse de l'Aminohydantoine:

S'obtient à partir de l'isocyanate de potassium et de l'hydrazino-acétate d'éthyle.



** Condensation de l'aminohydantoine avec le Nitrofurfural:



Scanned by CamScanner

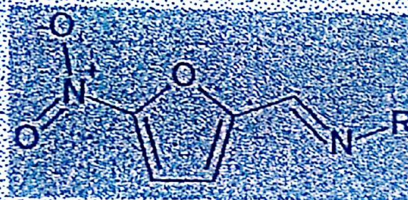
✓ *Propriétés:*

- Produit jaune-orangé. Son point de fusion: 270- 272°C.
- Très peu soluble dans l'eau et l'alcool, soluble dans le diméthylformamide.

✓ *Emploi:* interne

Utilisé comme désinfectant urinaire, administré par voie buccale. orale
Ses indications principales sont les cystites non compliqués et les infections de l'arbre urinaire. → infect° de la vessie

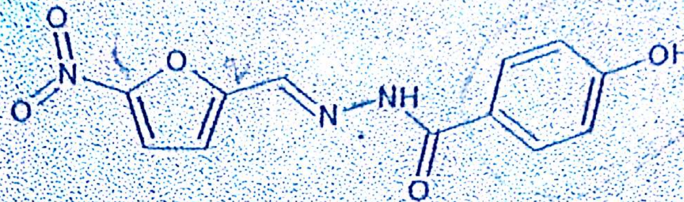
✓ *Nitrofuranes intestinaux:*



DCI	Spécialité	R
Furazolidone	FUROXANE	O, N, O
Nifuroxazide	ERCEFURYL	O, NH, OH

Nifuroxazide (DCI):

✓ **Structure:**



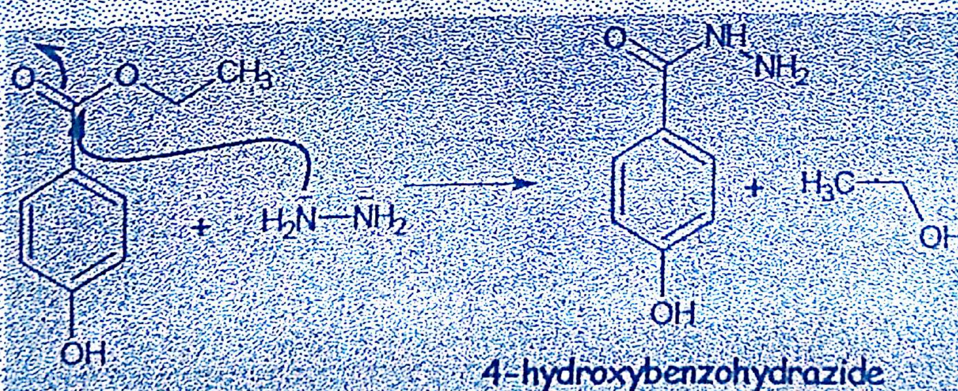
4-hydroxy-N-[(5-nitrofuran-2-yl)méthylène]benzohydrazide

✓ **Préparation:**

Se fait par condensation du Nitrofurfural avec l'hydrazide parahydroxybenzoïque : (4-hydroxybenzohydrazide).

** Synthèse du 4-hydroxybenzohydrazide :

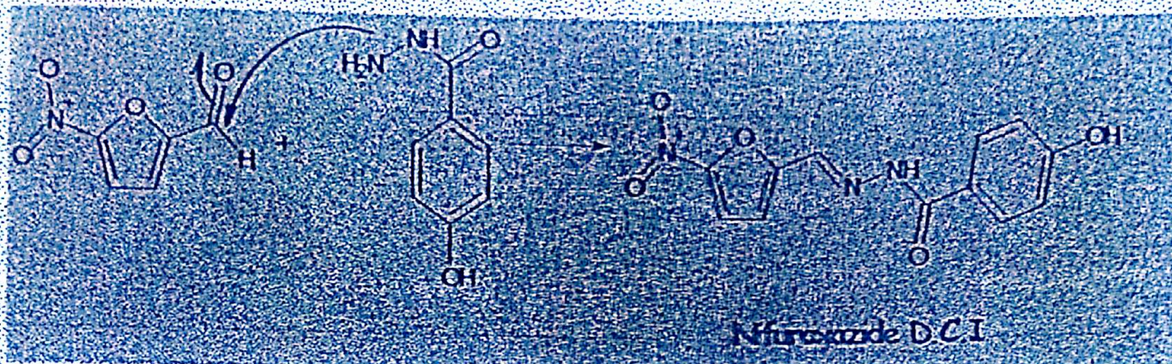
En traitant le p-hydroxybenzoate d'éthyle par l'hydrazine.



4-hydroxybenzohydrazide

Scanned by CamScanner

** Condensation de l'hydrazide parahydroxybenzoïque avec le Nitrofurfural:

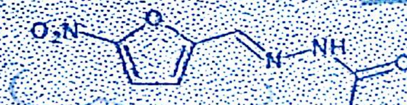


✓ *Emploi:*

Antiseptique **intestinal** qui ne franchit pas la barrière intestinale. Utilisé contre les diarrhées , les toxi-infections alimentaires, les salmonelloses......etc

✓ **Relation Structure-Activité:**

- Le noyau est à la base de nombreux médicaments antiseptiques, à condition d'avoir la structure:



- L'intégrité de la fonction **nitro est indispensable** à l'activité antiseptique.

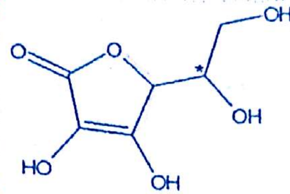
- Dans l'organisme la fonction **nitro est réduite**, le composé se lie avec l'**ADN microbien** en provoquant la cassure et le développement des formes filamenteuses géantes et dégénérées.

Vit : molécule agit à très faible dose
Vit C = appartient de la classe des grands vit

B- Acide L-ascorbique officinal:

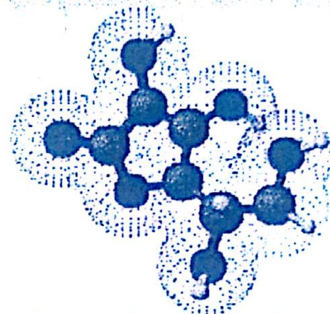
Dérivé oxygéné du furanne;

✓ ***Structure:***



Acide L- ascorbique (DC)

Vitamine C

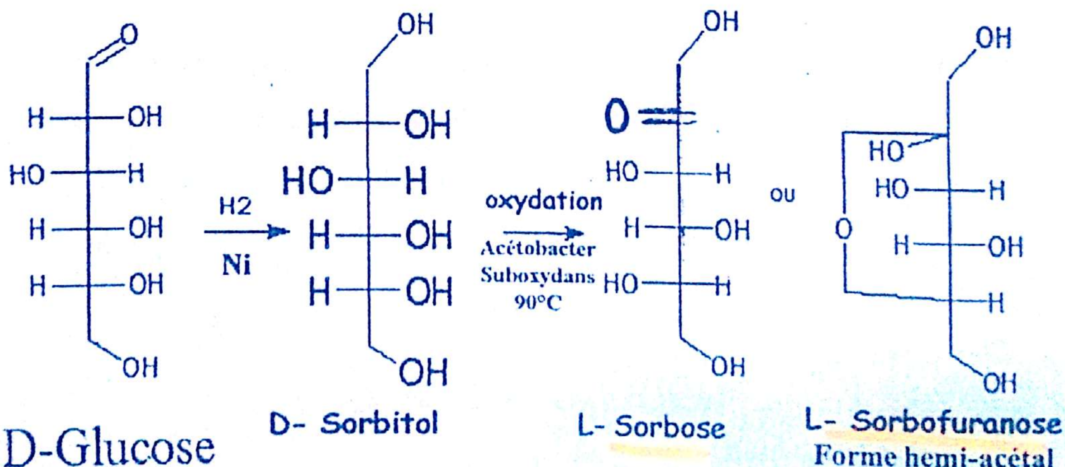


✓ ***Préparation:***

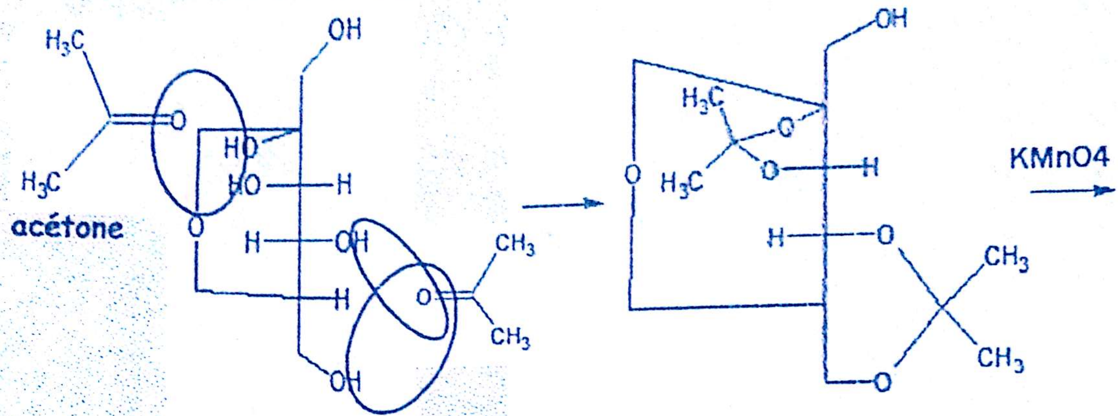
Parmi les synthèse qui ont été proposées, ce sont certainement celles qui utilisent comme matière première le sucre le plus accessible, le glucose, qui sont les plus employées. Les processus fermentaires sont très largement utilisés.
Cette préparation se fait en plusieurs étapes:

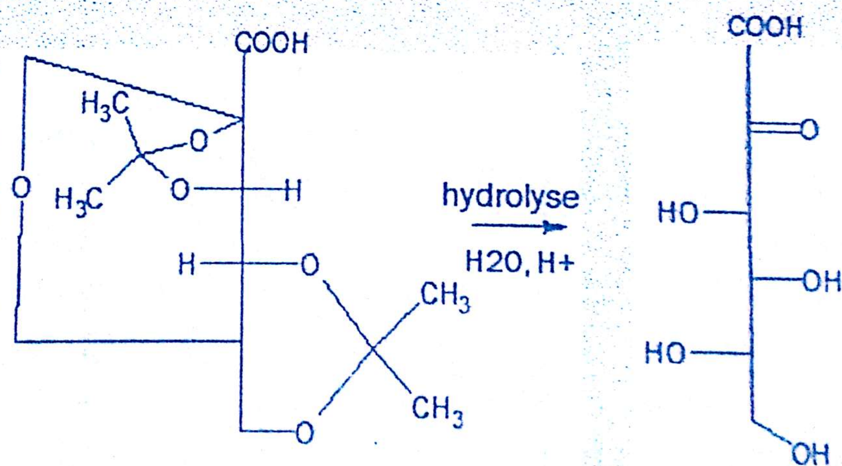
5 [1,2-dihydroxyéthyl] 3,4-dihydroxy furane (5H) one

(1) ✓ Obtention du L-Sorbose:



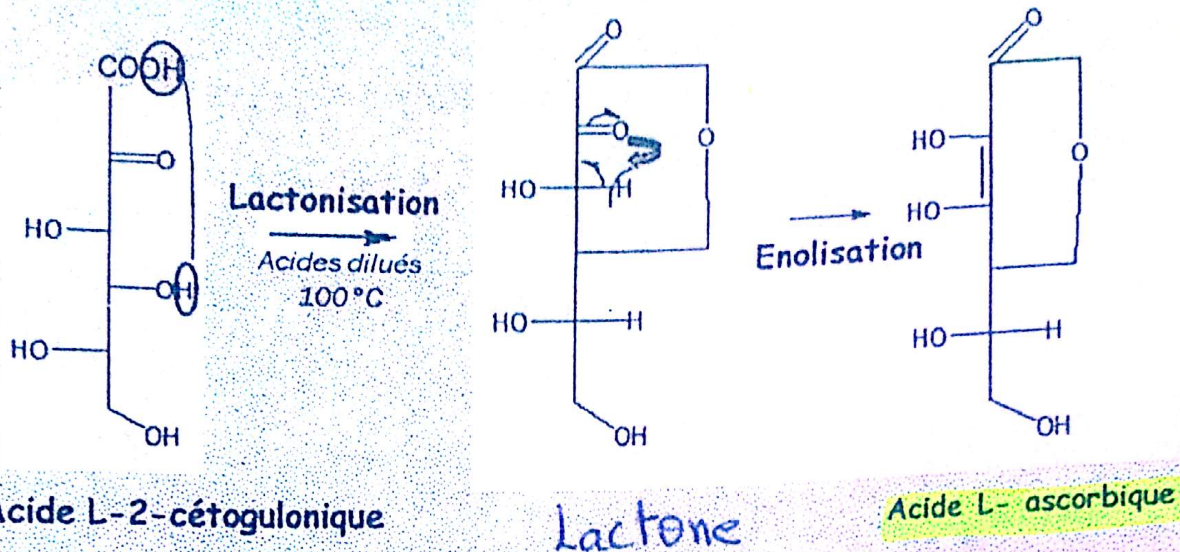
✓ Passage de la L-Sorbofuranose à l'acide L-2-cétogulonique :





Acide L-2-cétogulonique

✓ Obtention de l'acide L- Ascorbique:



✓ Propriétés physicochimiques:

** Physiques:

L'acide ascorbique est soluble dans l'eau; s'altérant à l'air et à la lumière, stable à la chaleur.

Point de fusion: 190 - 192°C.

** Chimiques: due aux groupement ène-diol

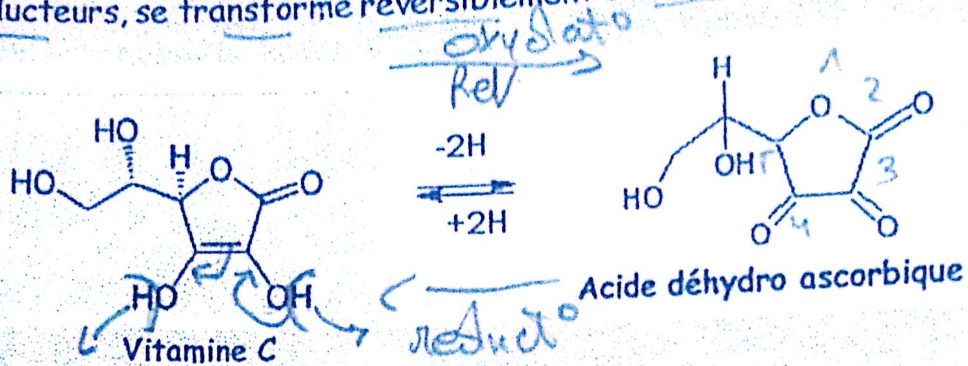
1) ▪ **Acidité:**

La solution aqueuse d'acide ascorbique présente une réaction acide vis-à-vis du Rouge Congo ; ces propriétés acides (monoacide) trouvent leur explication dans l'existence des groupes ènols.

② Oxydation:

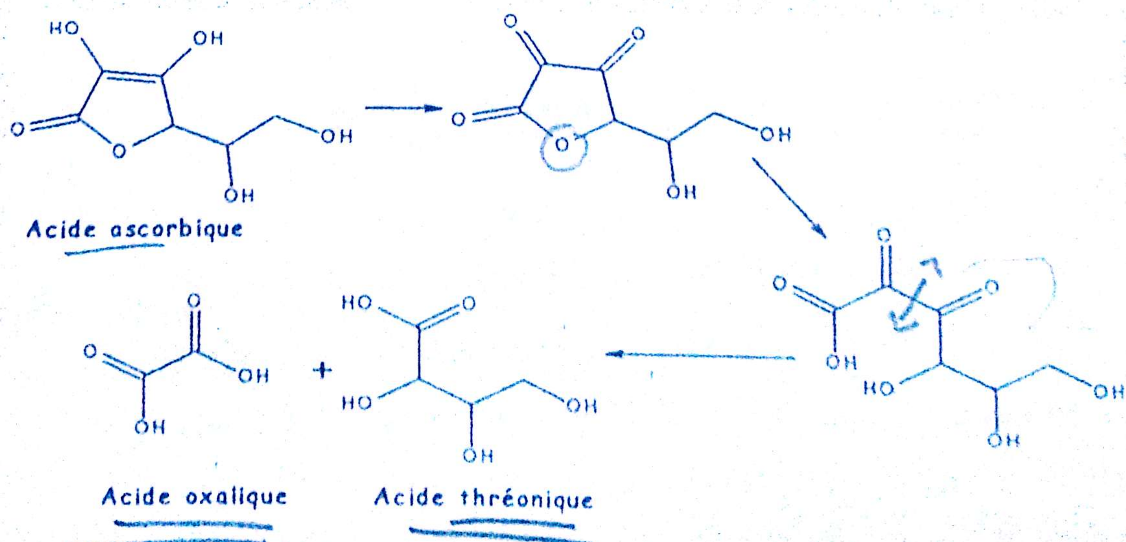
** *Oxydation ménagée:*

Conduit à l'acide déhydroascorbique, qui, traité par les réducteurs, se transforme réversiblement en acide ascorbique.



** *Oxydation poussée:*

Conduit à une ouverture du cycle en donnant de l'acide oxalique et l'acide thréonique.



- **Réduction:** AgNO3

La solution aqueuse de l'acide ascorbique réduit à froid la liqueur de Fehling et le nitrate d'argent et décolore immédiatement une solution de dichlorophénol-indophénol.
(colorat° bleue)

✓ *Emploi:*

-L'acide ascorbique est prescrit dans le scorbut et les manifestations pré-scorbutique .
- Chez le nourrisson, il facilite la croissance des os et des dents.
-On utilise également dans certains états infectieux, dans les hémorragies, dans les anémies, les intoxications par le benzène (benzolisme).
- Utilisé aussi en association avec des antalgiques antipyrétiques.
مسكن خافض الحرارة

MERCI......